

本PDF文件由

免费提供, 全部信息请点击[132875-61-7](#), 若要查询其它化学品请登录[CAS号查询网](#)

如果您觉得本站对您的学习工作有帮助, 请与您的朋友一起分享:) [爱化学www.ichemistry.cn](#)

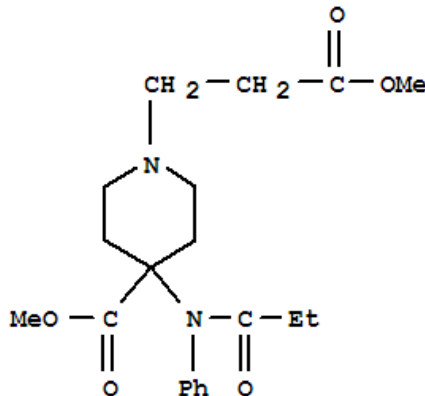
CAS Number:132875-61-7 基本信息

中文名: 瑞芬太尼;
雷米芬太尼;
瑞伐托酯;
4-((1-氧羰基)-4-[(1-氧丙基)苯氨基]-1-哌啶丙酸甲酯

英文名: 1-Piperidinepropanoicacid, 4-(methoxycarbonyl)-4-[(1-oxopropyl)phenylamino]-, methyl ester

别名: GI 87084X;
Ramifentanyl;
Remifentanil;
Remifentanyl;
Ultiva

分子结构:



分子式: $C_{20}H_{28}N_2O_5$

分子量: 376.45

CAS登录号: 132875-61-7

物理化学性质

瑞芬太尼 (132875-61-7) 的性状:

性质描述: 1. [盐酸](#)瑞芬太尼 (Remifentanil hydrochloride): $C_{20}H_{28}N_2O_5 \cdot HCl$ 。白色至类白色粉末;
2. pK_a 为 7.07。在正辛醇:水之间的分配系数为 17.9 (pH 7.3)。

CAS#132875-61-7 化学试剂供应商 (点击生产商链接可查看价格)

供应商信息已更新, 请登录爱化学 [CAS No. 132875-61-7 查看](#)
若您在此化学品供应商, 请按照[化工产品收录](#)说明进行免费添加

其他信息

产品应用: 瑞芬太尼 (132875-61-7) 主要用于麻醉时止痛。

1. 瑞芬太尼 (132875-61-7) 的生产方法:
4-甲氧羰基-4-[(1-氧丙基)苯氨基]哌啶溶于乙腈, 形成的溶液在室温加到丙烯酸甲酯中, 然后在 50℃ 搅拌 2h, 得到 瑞芬太尼 (132875-61-7)。

2. (1) 药理毒理

	<p>本药为芬太尼类μ型阿片受体激动剂，在人体内1分钟左右迅速达到血-脑平衡，在组织和血液中被迅速水解，故起效快，维持时间短，与其它芬太尼类似物明显不同。本药的镇痛作用及其副作用呈剂量依赖性，与催眠药、吸入性麻醉药和苯二氮卓类药物合用有协同作用。本药的μ型阿片受体激动作用可被纳洛酮所拮抗。另外本药也可引起呼吸抑制、骨骼肌（如胸壁肌）强直、恶心呕吐、低血压和心动过缓等，在一定剂量范围内，随剂量增加而作用加强。盐酸瑞芬太尼剂量高达30μg/kg静脉注射（1分钟内注射完毕）不会引起血浆组胺浓度的升高。遗传毒性：本药的原核细胞基因突变试验、大鼠肝细胞程序外DNA合成试验（UDS）、基因断裂试验（CHO细胞）和小鼠微核试验的结果均为阴性；但有代谢活化剂存在，体外小鼠淋巴细胞试验出现致突变作用。生殖毒性：①一般生殖毒性：本药0.5mg/kg（按体表面积mg/m²计算，相当于临床最大推荐人用剂量的40倍）连续静脉注射70多天，雄性大鼠的生育力降低；雌性大鼠交配前静脉注射本药1mg/kg15天，其生育力未受影响。②致畸敏感期毒性：大鼠和家兔分别静脉注射本药5mg/kg和0.8mg/kg（按体表面积mg/m²计算，相当于临床最大推荐人用剂量的400倍和125倍）未见致畸作用。怀孕兔和大鼠注射放射性标记的本药后，发现其通过胎盘并进入胎仔体内。③围产期毒性：大鼠围产期静脉注射本药5mg/kg（按体表面积mg/m²计算，相当于临床最大推荐人用剂量的400倍），对F1代大鼠的存活、发育和生殖能力未见明显影响。其它：甘氨酸(静脉注射剂的常用辅料)为本品的辅料。犬鞘内注射无本药的甘氨酸后，出现兴奋激动、疼痛、后肢功能失常、共济失调，因此可认为此作用为甘氨酸所致；但上述动物表现与本品制剂静脉注射给药无关。</p> <p>（2）药代动力学</p> <p>静脉给药后，本药快速起效，1分钟可达有效浓度，作用持续时间仅5～10分钟。药物浓度衰减符合三室模型，其分布半衰期（t₁/2α）为1分钟；消除半衰期（t₁/2β）为6分钟；终末半衰期（t₁/2γ）为10-20分钟；有效的生物学半衰期约3-10分钟，与给药剂量和持续给药时间无关。血浆蛋白结合率约70%，主要与α-1-酸性糖蛋白结合。稳态分布容积约350ml/kg，清除率大约为40ml/分钟/kg。本药代谢不受血浆胆碱酯酶及抗胆碱酯酶药物的影响，不受肝、肾功能及年龄、体重、性别的影响，主要通过血浆和组织中非特异性酯酶水解代谢，大约95%的本药代谢后经尿排泄，主代谢物活性仅为本药的1/4600。本品长时间输注给药或反复注射用药其代谢速度无变化，体内无蓄积。</p> <p>（3）适应症</p> <p>用于全麻诱导和全麻中维持镇痛。</p> <p>（4）用法和用量</p> <p>本品只能用于静脉给药，特别适用于静脉持续滴注给药。本品给药前须用以下注射液之一溶解并定量稀释成25μg/ml、50μg/ml或250μg/ml浓度的溶液：灭菌注射用水；5%葡萄糖注射液；0.9%氯化钠注射液；5%葡萄糖氯化钠注射液；0.45%氯化钠注射液。本品不含任何抗菌剂和防腐剂，因此在稀释的过程中应保持无菌状态，配制后应尽快使用，如需保存，于室温下保存不超过24小时，未使用完的稀释液应丢弃。本品用上述注射液稀释后可以与乳酸林格氏液或5%葡萄糖乳酸林格氏液共行一个快速静脉输液通路。本品连续输注给药，必须采用定量输注装置，可能情况下，应采用专用静脉输液通路。本品停药后，应清洗输液通路以防止残留本药的无意输入，避免当其它药物经同一输液通路给药时，可能出现呼吸抑制及胸壁肌强直。1. 麻醉诱导：本品应与催眠药（如丙泊酚、硫喷妥、咪达唑仑、笑气、七氟烷或氟烷）一并给药用于麻醉诱导。成人按每公斤体重0.5-1μg的输注速率持续静滴。也可在静滴前给予每公斤体重0.5-1μg的初始剂量静推，静推时间应大于60秒。2. 气管插管病人的麻醉维持：在气管插管后，应根据其他麻醉用药，依照上表指示减少本品输注速率。由于本品起效快，作用时间短，麻醉中的给药速率可以每2-5分钟增加25-100%或减小25-50%，以获得满意的μ阿片受体的药理反应。病人反应麻醉过浅时，每隔2-5分钟给予0.5-1μg/kg剂量静脉推注给药，以加深麻醉深度。</p> <p>（5）不良反应</p> <p>本品具有μ阿片受体类药物的典型不良反应，典型的不良反应有恶心、呕吐、呼吸抑制、心动过缓、低血压和肌肉强直，上述不良反应在停药或降低输注速度后几分钟内即可消失。在国内外的临床研究中还发现有寒战、发热、眩晕、视觉障碍、头痛呼吸暂停、瘙痒、心动过速、高血压、激动、低血氧症、癫痫、潮红和过敏。另外还有一些较少见的不良反应：消化系统：便秘、腹部不适、口干、胃食管反流、吞咽困难、腹泻、烧心、肠梗阻。心血管系统：心肌缺血、晕厥。肌肉骨骼系统：肌肉强直、胸痛。呼吸系统：咳嗽、呼吸困难、支气管痉挛、喉痉挛、喘鸣、鼻充血、咽炎、胸水、肺水肿、支气管炎、鼻漏。精神神经系统：焦虑、不自主运动、震颤、定向力障碍、幻觉、烦躁不安、恶梦、感觉异常、健忘。皮肤：皮疹、荨麻疹。泌尿系统：尿潴留、少尿、尿路中断。血液系统：贫血、淋巴细胞减少、白细胞减少、血小板减少。</p> <p>（6）禁忌</p> <p>本品不能单独用于全麻诱导，即使大剂量使用也不能保证使意识消失。</p> <p>本品处方中含有甘氨酸，因而不能于硬膜外和鞘内给药。</p> <p>已知对本品中各种组分或其它芬太尼类药物过敏的病人禁用。</p> <p>重症肌无力及易致呼吸抑制病人禁用。</p>
生产方法及其他：	

	<p>禁与单胺氧化酶抑制药合用。</p> <p>禁与血、血清、血浆等血制品经同一路径给药。</p> <p>支气管哮喘病人禁用。</p> <p>(7) 注意事项</p> <p>本品为国家特殊管理的麻醉药品，务必严格遵守国家对麻醉药品的管理条例，医院和病室贮药处均应双人双锁，处方颜色应与其它处方区别开。各级负责保管人员均应遵守交接班制度，不可稍有疏忽。</p> <p>本品能引起呼吸抑制和窒息，需在呼吸和心血管功能监测及辅助设施完备的情况下，由具有资格的和有经验的麻醉师给药。</p> <p>在推荐剂量下，本品能引起肌肉强直。肌肉强直的发生与给药剂量和给药速率有关，因此，单剂量注射时应缓慢给药，给药时间应不低于60秒；提前使用肌肉松弛药可防止肌肉强直的发生。本品引起的肌肉强直必须根据病人的临床状况采取合适的方法处置。麻醉诱导过程中出现的严重肌肉强直应给予神经肌肉阻断剂和/或另加催眠剂，并给予插管通气。在本品使用过程中发现的肌肉强直也可通过停止给药或减小给药速率处置，在停止给药后几分钟内肌肉强直可解除；或者给予阿片受体拮抗剂，但这样会逆转或抑制本品的镇痛作用，一般不推荐这样使用。出现危及生命的肌肉强直时，应给予迅速起效的神经肌肉阻断剂或立即中断输注。</p> <p>心律失常，慢性梗阻性肺部疾患，呼吸储备力降低及脑外伤昏迷、颅内压增高、脑肿瘤等易陷入呼吸抑制的病人慎用。</p> <p>本品务必在单胺氧化酶抑制药（如呋喃唑酮、丙卡巴肼）停用14天以上，方可给药，而且应先试用小剂量，否则会发生难以预料的严重的并发症。</p> <p>使用本品出现呼吸抑制时应妥善处理，包括减小输注速率50%或暂时中断输注。本品即使延长给药也未发现引起再发性呼吸抑制，但由于合用麻醉药物的残留作用，在某些病人身上停止输注后30分钟仍会出现呼吸抑制，因此，保证病人离开恢复室前完全清醒和足够的自主呼吸非常重要。</p> <p>本品能引起剂量依赖性低血压和心动过缓，可以预先给予适量的抗胆碱能药（如葡萄糖吡咯或阿托品）抑制这些反应。低血压和心动过缓可通过减小本品输注速率或合用药物来处置，在合适的情况下使用输液、升压药或抗胆碱能药。</p> <p>本品停止给药后5-10分钟，镇痛作用消失。对预知需要术后镇痛的病人，在中止本品给药前需给予适宜的替代镇痛药，并且必须有足够的时间让其达到最大作用，选择镇痛药应适合病人的具体情况和护理水平。</p> <p>在非麻醉诱导情况下，不得以病人的意识消失为药效目标而使用本品。</p> <p>本品不含任何抗菌剂和防腐剂，因此在稀释的过程中应保持无菌状态，稀释后的溶液应及时使用，没使用完的稀释液应丢弃。</p> <p>肝肾功能受损的病人不需调整剂量。肝肾功能严重受损的病人对本药呼吸抑制的敏感性增强，使用时应监测。</p> <p>(8) 孕妇及哺乳期妇女用药</p> <p>本品可通过胎盘屏障，产妇应用时有引起新生儿呼吸抑制的危险。本品能经母乳排泄，因而孕妇及哺乳期妇女不推荐使用。在必须使用时，医生应权衡利弊。</p> <p>(9) 儿童用药</p> <p>2-12岁儿童用药与成人一致。因尚没有临床资料，2岁以下儿童不推荐使用。</p> <p>(10) 老年患者用药</p> <p>随着患者年龄增长，本药药理效应增强。65岁以上老年患者用药时初始剂量为成人剂量的一半，持续静滴给药剂量应酌减。</p> <p>(11) 药物相互作用</p> <p>在动物体内，本药不延长丁二酰胆碱肌肉麻痹持续时间。麻醉过程中本品与硫喷妥、异氟烷、丙泊酚或羟基安定等联合用药，不改变本药的清除率。体外研究表明，阿曲库铵、米哇库铵、艾司洛尔、二乙氧磷酰硫胆碱、新斯的明、毒扁豆碱和咪达唑仑等药物不抑制本药在人体血液中的水解。本品与其它麻醉药有协同作用，硫喷妥、异氟烷、丙泊酚及咪达唑仑与本品同时给药时，剂量减至75%。中枢神经系统抑制药物与本品也有协同作用，合用时应慎重，并酌情减量；如果同时给药时不减少剂量，在病人身上会增加与这些药物有关的不良反应发生率。</p> <p>(12) 药物过量</p> <p>药物过量症状包括窒息、胸壁肌强直、癫痫、缺氧、低血压和心动过缓等。如果出现药物过量或怀疑药物过量，立即中断给药，维持开放气道，吸氧并维持正常的心血管功能。如呼吸抑制与肌肉强直有关，需给予神经肌肉阻断剂或μ阿片拮抗剂，并辅助呼吸。输液和增压药及其它辅助方法可用来处置低血压。葡萄糖吡咯或阿托品用于处置心动过缓或低血压。阿片拮抗剂（如纳络酮）作为特异性解毒剂，用于处置严重呼吸抑制或肌肉强直。</p> <p>(13) 贮藏：2-25℃遮光密封保存。</p> <p>(14) 有效期：暂定24个月。</p>
--	--

相关化学品信息

[帕罗格列](#) [苯甲酸丁酯](#) [3-溴异烟酸](#) [胭脂树橙](#) [单-9-十八烯酸-D-山梨糖醇酯](#) [吉他霉素](#) [叠氮氯霉素](#) [三氧化钼](#) [1-氯-4-\(2-氯乙氧基\)苯](#) [马来酸二异辛酯](#) [S-\(三氟甲基\)二苯并噻吩喹四氟硼酸盐](#) [13964-23-3](#) [4-氯-3-硝基吡啶](#) [氧化铯](#) [奥氮平](#) [溴乙烯](#) [2-巯基丙酸](#) [对羟基苯甲醛](#)